



(12) 发明专利申请

(10) 申请公布号 CN 101837022 A

(43) 申请公布日 2010.09.22

(21) 申请号 201010182370.3

(22) 申请日 2010.05.25

(71) 申请人 耿福能

地址 610031 四川省成都市营门口路 88 号  
四威大厦 B 座 15 楼

(72) 发明人 耿福能 刘彬 黄婉怡 胡若瑛  
杜江

(51) Int. Cl.

A61K 35/64 (2006.01)

A61P 1/04 (2006.01)

A61K 33/06 (2006.01)

权利要求书 2 页 说明书 5 页

(54) 发明名称

一种治疗胃炎和消化性溃疡的美洲大蠓药物  
组合物及其制备方法

(57) 摘要

本发明公开了一种治疗胃炎和消化性溃疡的美洲大蠓药物组合物,主要是由美洲大蠓提取物和石膏混合制得的有效成分混合物组成,按重量计,其配比为:美洲大蠓提取物:石膏=0.8~1.2g:2.5~40g。治疗胃炎和消化性溃疡的美洲大蠓药物组合物的制备方法,包括以下步骤:美洲大蠓提取物的制备、有效成分的混合、成药。本发明制备方法简单,充分发挥了美洲大蠓提取物的作用,有效提高了对胃炎和消化性溃疡疾病的疗效。

1. 一种治疗胃炎和消化性溃疡的美洲大蠓药物组合物,其特征在于:所述药物组合物主要是由美洲大蠓提取物和石膏混合制得的有效成分混合物组成,按重量份计,其配比为:美洲大蠓提取物:石膏=0.8~1.2:2.5~40。

2. 根据权利要求1所述治疗胃炎和消化性溃疡的美洲大蠓药物组合物,其特征在于:所述美洲大蠓提取物和石膏,按重量份计,其配比为:美洲大蠓提取物:石膏=1:21.25。

3. 根据权利要求1所述治疗胃炎和消化性溃疡的美洲大蠓药物组合物,其特征在于:所述药物组合物还包括纯化水和甘油,以1000g重量计的含美洲大蠓提取物和石膏的有效成分混合物,其配比为:有效成分混合物:纯化水:甘油=1000g:800~1200ml:4~6ml。

4. 根据权利要求3所述治疗胃炎和消化性溃疡的美洲大蠓药物组合物,其特征在于:所述以1000g重量计的含美洲大蠓提取物和石膏的有效成分混合物,其配比为:有效成分混合物:纯化水:甘油=1000g:1000ml:5ml。

5. 根据权利要求1所述治疗胃炎和消化性溃疡的美洲大蠓药物组合物的制备方法,其特征在于:所述制备方法包括以下步骤:

①、美洲大蠓提取物的制备:

a、粗碎:将干燥的美洲大蠓进行粉碎,制得美洲大蠓粗粉,备用;

b、浸泡:按照每100kg的粗粉加入3~5倍量的水,在70~78℃的温度条件下浸泡0.5~2小时制得粗粉混合液,备用;

c、三次提取:粗粉混合液采用煎煮的方法进行三次提取,对粗粉混合液进行第一次提取时,提取时间为7~9小时;然后向经第一次提取后的余液中加入余液2~4倍量的水后进行第二次提取,提取时间为5~7小时;最后向经第二次提取后的余液中加入余液2~4倍量的水后进行第三次提取,提取时间为3~5小时,分别制得三次的提取液,备用;

d、第一次过滤:将三次的提取液合并混合,然后进行过滤制得一级滤液,备用;

e、第一次浓缩:将一级滤液浓缩至70~90℃时相对密度为1.05~1.25的一级浓缩液,备用;

f、醇化处理:向一级浓缩液中逐渐加入浓度为93~97% w/w的乙醇,并充分搅拌,使其含醇量达到45~55%为止,在70~90℃的温度条件下保温20~40分钟,然后静置10~14小时,制得醇化液,备用;

g、第二次过滤:将醇化液弃去上层油脂,下层药液进行过滤制得二级滤液,备用;

h、第二次浓缩:将二级滤液进行乙醇回收处理后,浓缩至70~90℃时相对密度为1.15~1.30的二级浓缩液,备用;

i、膏剂制备:将二级浓缩液在常压条件下浓缩至水分≤25~35%的膏剂,即得含美洲大蠓提取物,备用;

②、有效成分的混合:按照美洲大蠓提取物:石膏=0.8~1.2:2.5~40的重量份比进行称量、混合,制得有效成分混合物,备用;

③、成药:按照有效成分混合物:纯化水:甘油=1000g:800~1200ml:4~6ml的重量比向有效成分混合物中加入纯化水和甘油,充分搅拌均匀,经板框过滤,滤液煮沸30分钟后,分装成100ml/瓶或50ml/瓶,再经高温高压灭菌消毒,冷至室温,即得成药。

6. 根据权利要求5所述治疗胃炎和消化性溃疡的美洲大蠓药物组合物的制备方法,其

特征在于：所述步骤 b 中加水量为 4 倍量，浸泡时间为 1 小时，浸泡温度为 74℃。

7. 根据权利要求 5 所述治疗胃炎和消化性溃疡的美洲大蠊药物组合物的制备方法，其特征在于：所述步骤③中的高温高压灭菌消毒是在温度 115 ~ 127℃、压力为 0.05 ~ 0.15Mpa 的条件下进行灭菌消毒，灭菌时间为 25 ~ 35 分钟。

## 一种治疗胃炎和消化性溃疡的美洲大蠊药物组合物及其制备方法

### 技术领域

[0001] 本发明涉及医药技术领域,具体来讲涉及一种治疗胃炎和消化性溃疡的美洲大蠊药物组合物及其制备方法。

### 背景技术

[0002] 据文献记载,美洲大蠊是蜚蠊科中体积最大的昆虫,原产于南美洲,美洲大蠊是传统的中药材,以干燥和鲜成虫入药,其性寒味咸,有毒,有辛辣味,有散瘀、消积、解毒、利水、消肿等功能;主治儿童疳积、扁桃腺炎、身体包块、痈疮肿痛和蜈蚣、毒蛇咬伤等。

[0003] 近年来随着科技不断地发展,经多年研究发现,美洲大蠊表皮含有巩膜质和甲壳质,溴、锌、镍、猛、钾、钙、钛、氯、硫、硅、铝、镁等元素;肌肉水解 13 种氨基酸;其醇提取物对癌细胞有明显的抑制作用,对心血管疾病具有明显的疗效。此外,身体贮藏维生素 B<sub>1</sub>、B<sub>2</sub>,烟酸和抗坏血酸等,淋巴含海藻糖、海藻糖酶、糖蛋白、肌醇、原儿茶酸葡萄糖甙等。全体含麦角硫因、龙虾肌碱、胡芦巴碱、甘氨酸、甜菜碱、肌碱、三甲胺、腺嘌呤等。临床主要应用有:治疗儿童疳积、治痈疮肿毒、治蜈蚣伤、治无名肿毒、治虫蛇咬伤。还有美洲大蠊与草药配伍可辅助治疗结肠癌。美洲大蠊提取物可治乙型肝炎,提取物 AT-2 制剂可主治原发性肝癌、心血管疾病等。

[0004] 公告号为 CN 100525781C,名称为“美洲大蠊提取物、含该提取物的药物组合物及其制备方法”和公开号为 CN1943600A,名称为“含有美洲大蠊及其乙醇提取物的药物组合物及其新用途”是申请人于 2006 年申请的两项和美洲大蠊提取物相关的专利文献,其公开了美洲大蠊提取物的制备方法和部分医药用途,近年来,随着对美洲大蠊提取物的进一步研究,美洲大蠊提取物在医药上的用途得到了进一步的发展。

[0005] 石膏是单斜晶系矿物,主要化学成分是硫酸钙(CaSO<sub>4</sub>)。石膏是一种用途广泛的工业材料和建筑材料。可用于水泥缓凝剂、石膏建筑制品、模型制作、医用食品添加剂、硫酸生产、纸张填料、油漆填料等。在中医领域,石膏可用于治热病壮热不退,心烦神昏,谵语发狂,口渴咽干,肺热喘急,中暑自汗,胃火头痛、牙痛,热毒壅盛,发斑发疹,口舌生疮。煅敷生肌敛疮。外治痈疽疮疡,溃不收口,汤火烫伤。然而临床验证结果表明石膏对治疗胃炎和消化性溃疡无疗效。

### 发明内容

[0006] 本发明的目的在于克服上述技术不足,提供一种有效提高治愈率的治疗胃炎和消化性溃疡的美洲大蠊药物组合物及其制备方法。

[0007] 本发明的目的通过以下技术方案来实现的:一种治疗胃炎和消化性溃疡的美洲大蠊药物组合物,所述药物组合物主要是由美洲大蠊提取物和石膏混合制得的有效成分混合物组成,按重量份计,其配比为:美洲大蠊提取物:石膏=0.8~1.2:2.5~40。优选配比为:美洲大蠊提取物:石膏=1:21.25。

[0008] 所述药物组合物还包括纯化水和甘油,以 1000g 重量计的含美洲大蠊提取物和石膏的有效成分混合物,其配比为:有效成分混合物:纯化水:甘油=1000g:800~1200ml:4~6ml。优选方案的配比为:有效成分混合物:纯化水:甘油=1000g:1000ml:5ml。

[0009] 治疗胃炎和消化性溃疡的美洲大蠊药物组合物的制备方法,包括以下步骤:

[0010] ①、美洲大蠊提取物的制备:

[0011] a、粗碎:将干燥的美洲大蠊进行粉碎,制得美洲大蠊粗粉,备用;

[0012] b、浸泡:按照每 100kg 的粗粉加入 3~5 倍量的水,在 70~78℃ 的温度条件下浸泡 0.5~2 小时制得粗粉混合液,备用;其中,优选方案为:加入水的量为 4 倍量,浸泡时间为 1 小时,浸泡温度为 74℃;

[0013] c、三次提取:粗粉混合液采用煎煮的方法进行三次提取,对粗粉混合液进行第一次提取时,提取时间为 7~9 小时;然后向经第一次提取后的余液中加入余液 2~4 倍量的水后进行第二次提取,提取时间为 5~7 小时;最后向经第二次提取后的余液中加入余液 2~4 倍量的水后进行第三次提取,提取时间为 3~5 小时,分别制得三次的提取液,备用;

[0014] d、第一次过滤:将三次的提取液合并混合,然后进行过滤制得一级滤液,备用;

[0015] e、第一次浓缩:将一级滤液浓缩至 70~90℃ 时相对密度为 1.05~1.25 的一级浓缩液,备用;

[0016] f、醇化处理:向一级浓缩液中逐渐加入浓度为 93~97% w/w 的乙醇,并充分搅拌,使其含醇量达到 45~55% 为止,在 70~90℃ 的温度条件下保温 20~40 分钟,然后静置 10~14 小时,制得醇化液,备用;

[0017] g、第二次过滤:将醇化液弃去上层油脂,下层药液进行过滤制得二级滤液,备用;

[0018] h、第二次浓缩:将二级滤液进行乙醇回收处理后,浓缩至 70~90℃ 时相对密度为 1.15~1.30 的二级浓缩液,备用;

[0019] i、膏剂制备:将二级浓缩液在常压条件下浓缩至水分≤25~35% 的膏剂,即得含美洲大蠊提取物,备用;

[0020] ②、有效成分的混合:按照美洲大蠊提取物:石膏=0.8~1.2:2.5~40 的重量份比进行称量、混合,制得有效成分混合物,备用;

[0021] ③、成药:按照有效成分混合物:纯化水:甘油=1000g:800~1200ml:4~6ml 的重量比向有效成分混合物中加入纯化水和甘油,充分搅拌均匀,经板框过滤,滤液煮沸 30 分钟后,分装成 100ml/瓶或 50ml/瓶,再经高温高压灭菌消毒,冷至室温,即得成药。

[0022] 所述步骤③中的高温高压灭菌消毒是在温度 115~127℃、压力为 0.05~0.15Mpa 的条件下进行灭菌消毒,灭菌时间为 25~35 分钟。其中,优选方案为:消毒温度为 121℃,压力位 0.1Mpa,灭菌时间为 30 分钟。

[0023] 本发明制备方法简单,充分发挥了美洲大蠊提取物的作用,有效提高了对胃炎和消化性溃疡疾病的疗效。

## 具体实施方式

[0024] 以下结合实施例的具体实施方式再对本发明的上述内容作进一步的详细说明:

[0025] 一种治疗胃炎和消化性溃疡的美洲大蠊药物组合物,所述药物组合物主要是由美

洲大蠓提取物和石膏混合制得的有效成分混合物组成,按重量份计,其配比为:美洲大蠓提取物:石膏=0.8~1.2:2.5~40。优选配比为:美洲大蠓提取物:石膏=1:21.25。

[0026] 所述药物组合物还包括纯化水和甘油,以1000g重量计的含美洲大蠓提取物和石膏的有效成分混合物,其配比为:有效成分混合物:纯化水:甘油=1000g:800~1200ml:4~6ml。优选方案的配比为:有效成分混合物:纯化水:甘油=1000g:1000ml:5ml。

[0027] 治疗胃炎和消化性溃疡的美洲大蠓药物组合物的制备方法,包括以下步骤:

[0028] ①、美洲大蠓提取物的制备:

[0029] a、粗碎:将干燥的美洲大蠓进行粉碎,制得美洲大蠓粗粉,备用;

[0030] b、浸泡:按照每100kg的粗粉加入3~5倍量的水,在70~78℃的温度条件下浸泡0.5~2小时制得粗粉混合液,备用;其中,优选方案为:加入水的量为4倍量,浸泡时间为1小时,浸泡温度为74℃;

[0031] c、三次提取:粗粉混合液采用煎煮的方法进行三次提取,对粗粉混合液进行第一次提取时,提取时间为7~9小时;然后向经第一次提取后的余液中加入余液2~4倍量的水后进行第二次提取,提取时间为5~7小时;最后向经第二次提取后的余液中加入余液2~4倍量的水后进行第三次提取,提取时间为3~5小时,分别制得三次的提取液,备用;

[0032] d、第一次过滤:将三次的提取液合并混合,然后进行过滤制得一级滤液,备用;

[0033] e、第一次浓缩:将一级滤液浓缩至70~90℃时相对密度为1.05~1.25的一级浓缩液,备用;

[0034] f、醇化处理:向一级浓缩液中逐渐加入浓度为93~97% w/w的乙醇,并充分搅拌,使其含醇量达到45~55%为止,在70~90℃的温度条件下保温20~40分钟,然后静置10~14小时,制得醇化液,备用;

[0035] g、第二次过滤:将醇化液弃去上层油脂,下层药液进行过滤制得二级滤液,备用;

[0036] h、第二次浓缩:将二级滤液进行乙醇回收处理后,浓缩至70~90℃时相对密度为1.15~1.30的二级浓缩液,备用;

[0037] i、膏剂制备:将二级浓缩液在常压条件下浓缩至水分≤25~35%的膏剂,即得含美洲大蠓提取物,备用;

[0038] ②、有效成分的混合:按照美洲大蠓提取物:石膏=0.8~1.2:2.5~40的重量份比进行称量、混合,制得有效成分混合物,备用;

[0039] ③、成药:按照有效成分混合物:纯化水:甘油=1000g:800~1200ml:4~6ml的重量比向有效成分混合物中加入纯化水和甘油,充分搅拌均匀,经板框过滤,滤液煮沸30分钟后,分装成100ml/瓶或50ml/瓶,再经高温高压灭菌消毒,冷至室温,即得成药。

[0040] 所述步骤③中的高温高压灭菌消毒是在温度115~127℃、压力为0.05~0.15Mpa的条件下进行灭菌消毒,灭菌时间为25~35分钟。其中,优选方案为:消毒温度为121℃,压力位0.1Mpa,灭菌时间为30分钟。

[0041] 实施例1

[0042] 按照上述方法进行实施,将干燥的美洲大蠓粗碎,每100Kg粗粉加300Kg水,浸泡0.5小时后,温度约在70℃,提取三次,第一次7小时;第二次加水200Kg,提取5小时;第三次加水200Kg,提取3小时;合并三次提取液,过滤,滤液浓缩至相对密度为1.05~

1.08(70℃)时,加入浓度为93% w/w的乙醇,使成含醇量为40%,70℃保温搅拌20分钟,静置10小时,弃去上层油脂,下层药液过滤,滤液回收乙醇,减压浓缩至相对密度为1.15~1.18(70℃),常压浓缩至水分≤25%的膏,即得含美洲大蠊提取物,备用;按美洲大蠊提取物:石膏=0.8:2.5的重量份比,加入石膏混合制的有效成分混合物,然后按有效成分混合物:纯化水:甘油=1000g:800ml:4ml,加入纯化水和甘油,充分搅拌均匀,经板框过滤,滤液煮沸30分钟后,分装成100ml/瓶或50ml瓶,在温度为115℃,压力为0.05Mpa的条件下进行高温高压灭菌,灭菌时间为25分钟,冷至室温,即得成药。

#### [0043] 实施例2

[0044] 按照上述方法进行实施,将干燥的美洲大蠊粗碎,每100Kg粗粉加500Kg水,浸泡2小时后,温度约在78℃,提取三次,第一次9小时;第二次加水400Kg,提取7小时;第三次加水400Kg,提取5小时;合并三次提取液,过滤,滤液浓缩至相对密度为1.22~1.25(90℃)时,加入浓度为97% w/w的乙醇,使成含醇量为55%,90℃保温搅拌40分钟,静置14小时,弃去上层油脂,下层药液过滤,滤液回收乙醇,减压浓缩至相对密度为1.27~1.30(90℃),常压浓缩至水分≤35%的膏,即得含美洲大蠊提取物,备用;按美洲大蠊提取物:石膏=1.2:40的重量份比,加入石膏混合制的有效成分混合物,然后按有效成分混合物:纯化水:甘油=1000g:1200ml:6ml,加入纯化水和甘油,充分搅拌均匀,经板框过滤,滤液煮沸30分钟后,分装成100ml/瓶或50ml瓶,在温度为127℃,压力为0.15Mpa的条件下进行高温高压灭菌,灭菌时间为35分钟,冷至室温,即得成药。

#### [0045] 实施例3

[0046] 按照上述方法进行实施,将干燥的美洲大蠊粗碎,每100Kg粗粉加400Kg水,浸泡1小时后,温度约在74℃,提取三次,第一次8小时;第二次加水300Kg,提取6小时;第三次加水300Kg,提取4小时;合并三次提取液,过滤,滤液浓缩至相对密度为1.10~1.20(80℃)时,加入浓度为95% w/w的乙醇,使成含醇量为50%,80℃保温搅拌30分钟,静置12小时,弃去上层油脂,下层药液过滤,滤液回收乙醇,减压浓缩至相对密度为1.20~1.25(80℃),常压浓缩至水分≤30%的膏,即得含美洲大蠊提取物,备用;按美洲大蠊提取物:石膏=1:21.25的重量份比,加入石膏混合制的有效成分混合物,然后按有效成分混合物:纯化水:甘油=1000g:1000ml:5ml,加入纯化水和甘油,充分搅拌均匀,经板框过滤,滤液煮沸30分钟后,分装成100ml/瓶或50ml瓶,在温度为121℃,压力为0.1Mpa的条件下进行高温高压灭菌,灭菌时间为30分钟,冷至室温,即得成药。

#### [0047] 实施例4

[0048] 按照上述方法进行实施,将干燥的美洲大蠊粗碎,每100Kg粗粉加420Kg水,浸泡0.8小时后,温度约在76℃,提取三次,第一次7.5小时;第二次加水380Kg,提取5.5小时;第三次加水380Kg,提取3.5小时;合并三次提取液,过滤,滤液浓缩至相对密度为1.06~1.09(78℃)时,加入浓度为94% w/w的乙醇,使成含醇量为48%,76℃保温搅拌35分钟,静置13小时,弃去上层油脂,下层药液过滤,滤液回收乙醇,减压浓缩至相对密度为1.16~1.18(76℃),常压浓缩至水分≤28%的膏,即得含美洲大蠊提取物,备用;按美洲大蠊提取物:石膏=1.1:26的重量份比,加入石膏混合制的有效成分混合物,然后按有效成分混合物:纯化水:甘油=1000g:900ml:5.5ml,加入纯化水和甘油,充分搅拌均匀,经板框过滤,滤液煮沸30分钟后,分装成100ml/瓶或50ml瓶,在温度为124℃,压力为0.12Mpa

的条件下进行高温高压灭菌,灭菌时间为 32 分钟,冷至室温,即得成药。

[0049] 试验例:胃炎和消化性溃疡患者治愈率的临床试验数据

[0050] 一、一般资料:

[0051] 胃炎和消化性溃疡患者人数详见各表,其中胃炎患者约为 58%,消化性溃疡患者约为 42%,符合诊断标准。随机分为治疗组和对照组,男女不等,年龄 1~55 岁;两组患者年龄、性别和病程经统计学处理,差异无显著性意义,具有可比性。

[0052] 二、治疗方法:

[0053] 治疗组:本方案药物,口服,成人一次 0.8~1.2g,儿童三岁以下一次 0.3~0.5g,三岁以上一次 0.8~1g,一日三次。

[0054] 对照组:丽珠得乐,口服。成人一次 1 粒,一日 3 次;或一日 2 次,早晚各服 2 粒。

[0055] 三、临床试验数据(见表 1、2,其中 n 代表人数,百分比数值采取四舍五入保留小数点后两位)

[0056] 表 1:两组疗效比较

[0057]

组别	n	治愈		有效		无效		总有效率 %
		n	%	n	%	n	%	
治疗组	79	69	89.90	9	11.39	2	2.54	97.15
对照组	70	55	78.57	10	14.29	5	7.14	92.86

[0058] 表 2:两组 30 天疗效比较

[0059]

组别	n	30 天愈合患者数	30 天治愈率(%)
治疗组	79	69	89.90
对照组	70	55	78.57

[0060] 综合结论:由上述临床数据可见,治疗组疗效明显优于对照组。

[0061] 胃炎和消化性溃疡是临床常见病,可发生在任何年龄,有反复发作的特点。上述疾病的发生与多种因素有关,常见的有感染,免疫,缺锌等等。石膏是常用于治疗上述疾病的一种药物,有一定疗效。美洲大蠊是一种昆虫,俗称蟑螂,体内含有多种活性成分,其提取物主要成分为多元醇类及肽类活性物质,经药理研究证实具有促进上皮细胞、肉芽组织生长,促进创面修复,增强免疫的作用,但不具有抗菌作用,美洲大蠊提取物与石膏搭配使用,不仅可以抗感染,同时能促进溃疡组织修复,提高溃疡愈合率,缩短溃疡愈合时间,两者合用治疗上述疾病更有效。